

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2004-002260

(43)Date of publication of application : 08.01.2004

---

(51)Int.Cl.

A01N 63/02

A01N 43/50

A01N 53/12

---

(21)Application number : 2002-225957

(71)Applicant : BAYER CROPSOURCE KK

(22)Date of filing : 02.08.2002

(72)Inventor : ISONO KUNIHIRO  
HANAKI KATSUHIKO  
OTSU YUICHI  
SHIBUYA KATSUHIKO  
EMOTO AKIRA  
IKEGAMI NAOTO

---

(30)Priority

Priority number : 2002080647    Priority date : 22.03.2002    Priority country : JP

---

(54) IMPROVED AGROCHEMICAL COMPOSITION

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide an improved agrochemical composition having an increased absorbability of a macrolide compound as its active ingredient into rice plants.

SOLUTION: The improved agrochemical composition having an increased absorbability of a macrolide compound into rice plants contains the macrolide compound as its active ingredient and an alkaline earth metal carbonate.

---

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2004-2260

(P2004-2260A)

(43) 公開日 平成16年1月8日 (2004. 1. 8)

(51) Int. Cl. <sup>7</sup>

F I

テーマコード (参考)

AO 1 N 63/02

AO 1 N 63/02

Z

4 H 0 1 1

AO 1 N 43/50

AO 1 N 43/50

Q

AO 1 N 53/12

AO 1 N 53/00

5 1 0

審査請求 未請求 請求項の数 7 O L (全 10 頁)

(21) 出願番号 特願2002-225957 (P2002-225957)  
(22) 出願日 平成14年8月2日 (2002. 8. 2)  
(31) 優先権主張番号 特願2002-80647 (P2002-80647)  
(32) 優先日 平成14年3月22日 (2002. 3. 22)  
(33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(71) 出願人 000232564  
バイエルクロップサイエンス株式会社  
東京都港区高輪4丁目10番8号  
(74) 代理人 100060782  
弁理士 小田島 平吉  
(74) 代理人 100074217  
弁理士 江角 洋治  
(72) 発明者 磯野 邦博  
栃木県下都賀郡野木町丸林386-2-8  
O 1  
(72) 発明者 花木 克彦  
栃木県小山市神島谷856-1  
(72) 発明者 大津 悠一  
栃木県小山市駅南町1-5-7-1002

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 改良農薬組成物

(57) 【要約】

【課題】 農薬有効成分としてのマクロライド系化合物の  
稲体への吸収性が高められた改良農薬組成物を提供する

。【解決手段】 農薬有効成分としてのマクロライド系化合物とアルカリ土類金属炭酸塩を含有することを特徴とする、稲体へのマクロライド系化合物の吸収性が高められた改良農薬組成物及びその利用。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

農薬有効成分としてのマクロライド系化合物とアルカリ土類金属炭酸塩を含有することを特徴とする、稲体へのマクロライド系化合物の吸収性が高められた改良農薬組成物。

## 【請求項 2】

農薬有効成分として、更にイミダクロプリドを含有する請求項 1 に記載の改良農薬組成物。

## 【請求項 3】

農薬有効成分として、更にイミダクロプリド及びカルプロパミドを含有する請求項 1 に記載の改良農薬組成物。

## 【請求項 4】

アルカリ土類金属炭酸塩が炭酸カルシウム又は炭酸マグネシウムである請求項 1～3 のいずれかに記載の改良農薬組成物。

## 【請求項 5】

アルカリ土類金属炭酸塩が炭酸カルシウムである請求項 1～3 のいずれかに記載の改良農薬組成物。

## 【請求項 6】

請求項 1～5 のいずれかに記載の改良農薬組成物を用いることを特徴とする病害虫防除方法。

## 【請求項 7】

育苗箱施用による請求項 6 に記載の防除方法。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

## 【発明の属する技術分野】

本発明は改良農薬組成物に関する。更に詳しくは、農薬有効成分の稲体への吸収性が高められた改良農薬組成物に関する。

## 【0002】

## 【従来の技術】

農薬製剤ガイド（1997 年日本植物防疫協会発行）93～95 頁には、農薬製剤の担体について記載されており、そこには、鉱石を原料とする担体の例として炭酸カルシウムが挙げられている。

## 【0003】

特開昭 61-254506 号公報には、農薬活性成分のトリシクラゾールと酸とを担体に担持させてなる、トリシクラゾールの薬害が軽減され且つ残効性が延長された徐放性固状殺菌組成物が開示されており、そこには該担体の例として、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウムなどの無機塩類が挙げられている。

## 【0004】

特開平 6-263601 号公報には、練り込み粒剤に重量中位径 15  $\mu\text{m}$  以上の鉱物質微粉を配合してなる、農薬活性成分の溶出速度を高めた改良型農薬用粒剤が開示されており、該鉱物質微粉の例として炭酸カルシウム粉が挙げられている。

## 【0005】

更に、特開 2000-191406 公報には、農薬活性成分と多孔質炭酸カルシウム系化合物と界面活性剤とを含有する混合物を造粒してなる、水中崩壊性および水中分散性にすぐれた農薬粒状水和剤が開示されている。

## 【0006】

## 【発明が解決しようとする課題及びその解決手段】

農薬有効成分としてのマクロライド系化合物、例えばエマメクチン安息香酸塩は殺虫剤として有用であることが知られている（農薬要覧 1999 年、531 頁）。しかしながら、このようなマクロライド系化合物を含有する農薬組成物を、本田移植後の病害虫の防除を目的として、水稻稚苗の育苗箱に施用した場合、目的とする病害虫防除が有効且つ的確に現れないという重大な問題がある。

## 【0007】

本発明者らは、この問題の原因を検討した結果、稲体中への該有効成分の取り込み量が低いため、稲体を侵襲する害虫による有効成分の吸収量が少なくなり、結果として防除に足る有効成分量が害虫に取り込まず、害虫の死滅に至らないことが判明した。

## 【0008】

そこで、本発明者らは、稲体へのマクロライド系化合物の取り込み量を増大させる方法について鋭意検討を重ねた結果、今回、マクロライド系化合物にアルカリ土類金属炭酸塩を加えることにより、稲体への該化合物の取り込み量が格段に増大することを発見し、本発明を完成するに至った。

## 【0009】

かくして、本発明は、農薬有効成分としてのマクロライド系化合物とアルカリ土類金属炭酸塩を含有することを特徴とする、稲体へのマクロライド系化合物の吸収性が高められた改良農薬組成物を提供するものである。

## 【0010】

本発明によれば、驚くべきことに、マクロライド系化合物を含有する組成物にアルカリ土類金属炭酸塩を加えて調製した農薬粒剤を水稻稚苗の育苗箱に施用すると、稲体中へのマクロライド系化合物の取り込み量が著しく増大し、本田移植後の病害虫防除に極めて有効であり、本田移植後の稲体を侵襲する病害虫を的確に防除することができる。

## 【0011】

アルカリ土類金属炭酸塩の添加によるマクロライド系化合物の稲体への取り込み量の増大、それに伴う優れた病害虫防除効果の的確な発現という本発明によって達成される顕著な作用効果は従来技術からは全く予想外のことである。

## 【0012】

本発明の改良農薬組成物において、農薬有効成分としてのマクロライド系化合物としては、例えば、エマメクチン安息香酸塩、スピノサドなどが挙げられるが、これら

3

のみに限られるものではない。

#### 【0013】

本発明の改良農薬組成物は、必要に応じて、農薬有効成分として、上記のマクロライド系化合物に加えて、他の農薬有効成分を含有することもできる。この他の農薬有効成分としては、例えば、イミダクロプリド、チアクロプリド、チアメトキサム、クロチアニジン、ジノテフラン、ニテンピラム、アセタミプリド、カルプロパミド、ジクロサイメット、プロベナゾール、ピロキロン、トリシクラゾール等を挙げることができ、中でも、イミダクロプリド及びイミダクロプリドとカルプロパミドとの組み合わせが好適である。

#### 【0014】

本発明において、マクロライド系化合物の吸収促進剤として用いられるアルカリ土類金属炭酸塩の具体例には、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウムなどが挙げられ、特に、炭酸カルシウムが好適である。ここで「炭酸カルシウム」は、軽質炭酸カルシウム、及び石灰岩、大理石、貝殻等の炭酸カルシウム成分を含有するものである。

#### 【0015】

以上に述べたマクロライド系化合物及びアルカリ土類金属炭酸塩を必須成分として含有する本発明の農薬組成物は、実際の使用に際して、通常の農薬におけると同様に、例えば、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤形に製剤化することができる。中でも粒剤が好ましく、粒剤としては、被覆型（コーティング）粒剤及び練り込み粒剤のいずれのタイプのものであってもよい。被覆型粒剤の場合、アルカリ土類金属炭酸塩は、粉末として被覆層に加えてもよく及び／又は粒核として粒剤本体に含有させてもよい。また、練り込み粒剤の場合、アルカリ土類金属炭酸塩は粉末として加えることができる。

#### 【0016】

本発明の改良農薬粒剤はそれ自体既知の方法により製剤化することができる。例えば、被覆型粒剤を製造するに際しては、例えば粒核として非崩壊性粒を用い、これに水及び／又はバインダーを混合し、次いで、農薬有効成分にアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸カルシウム、界面活性剤、固体希釈剤等を加え混合粉碎し調製した原末を加え、よく混合した後、乾燥して被覆型粒剤を得ることができる。

#### 【0017】

上記被覆型粒剤の製造において、粒核として用いられる非崩壊性粒としては、例えば、炭酸カルシウム成分を含有する石灰岩や大理石等の鉱物の粉碎物、シリカサンド、軽石粒、クレー粒、造粒した非崩壊性粒等を挙げることができる。

#### 【0018】

バインダーとしては、例えば、水、糖類、デキストリン、ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アルギン酸ソーダ、ポリビニルアルコー

4

ル、酢酸ビニル樹脂エマルジョン、アクリル樹脂エマルジョン、アクリルスチレン共重合樹脂エマルジョン等を挙げることができるが、これらに限定されるものではない。

#### 【0019】

また、界面活性剤としては、例えば、リグニンスルホン酸塩、アルキルリン酸塩、脂肪酸塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物、ポリオキシアルキレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシアルキレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシアルキレントリスチリルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンーポリオキシプロピレンブロックポリマー硫酸塩、ジアルキルスルホサクシネート、ポリオキシアルキレンアルキルエーテルスルホサクシネート塩、ポリオキシアルキレンアルキルフェニルエーテルホスフェート塩等のアニオン系界面活性剤；ポリオキシアルキレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレン脂肪酸エステル、ポリオキシアルキレントリスチリルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンアルキルアミン、ソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシアルキレンソルビタンエステル、グリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンーポリオキシプロピレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンーポリオキシプロピレンブロックポリマーアルキルフェニルエーテル等のノニオン系界面活性剤；脂肪族アルキルベタイン、アルキルアンモニウム塩等の両性界面活性剤；アルキルピリジニウム塩、ポリエチレンポリアミン脂肪酸アミド等のカチオン系界面活性剤等を挙げることができる。

#### 【0020】

更に、補助剤として、ベントナイト等の固体希釈剤を含有せしめることもできる。また必要に応じて、着色料を混合してもよく、例えば、無機顔料（例えば、酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルー）、有機染料（例えば、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料）、微量元素（例えば、塩類又は鉄、マンガン、ボロン、銅、コバルト、モリブデン、亜鉛）などを挙げることができる。

#### 【0021】

他方、練り込み粒剤は、一般には、農薬有効成分と鉱物質微粉を主体として混合することにより製造することができるが、本発明においては、必須成分としてアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸カルシウム粉末を混合し、更に必要に応じて、他の鉱物質微粉、例えば、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、ベントナイト、酸性白土、けい藻土、タルク粉又はそれらの加工品等を加え、また場合により、ホホワイトカーボン、硫酸ナトリウム等の水溶性塩類、木粉等の植物由来の微粉等を加えて混合し、更に必要に応じて、水や前記被覆型粒剤にお

いて例示したと同様の界面活性剤、バインダー、着色料などを加えてよく混練し、エクストルーダーで押し出し造粒し、流動層乾燥機で乾燥した後、整粒することにより、本発明による練り込み粒剤を得ることができる。

#### 【0022】

本発明の改良農薬組成物において、アルカリ土類金属炭酸塩の配合量は、通常、マクロライド系化合物1重量部に対し、約5～約120重量部、好ましくは約10～約110重量部の範囲内が適当である。

#### 【0023】

本発明の改良農薬組成物には、上記各成分の他に、更に必要に応じて、他の補助剤、例えば安定化剤、薬害軽減剤等を適宜配合することができる。

#### 【0024】

次に、本発明を実施例により更に具体的に説明するが、本発明はこれらの実施例のみに限定されるものではない。なお、実施例の中で特に断りのない限り、数値の単位は重量部を表わす。

#### 【0025】

##### 【実施例】

##### 製剤例1（練り込み粒剤）

エマメクチン安息香酸塩1部、ホホワイトカーボン0.15部及び炭酸カルシウム0.25部を混合粉碎し、この粉碎混合物にベントナイト6部、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩2部及び炭酸カルシウムを加え混合する。この混合組成物に、水15部、リグニンスルホン酸ナトリウム2部及びポリオキシアルキレンアリアルフェニルエーテル硫酸のナトリウム塩2部を攪拌混合しながら加え、混練し、押し出し造粒し、乾燥後整粒することにより練り込み粒剤を得る。

##### 製剤例2（被覆型粒剤）

ポリオキシアルキレンアリアルフェニルエーテル硫酸のナトリウム塩0.5部、ジオクチルスルホコハク酸のナトリウム塩0.025部及び水1.875部の溶解させた混合物を炭酸カルシウム粒にスプレーし、攪拌して均

一に湿潤させる。この湿潤させた粒核に、エマメクチン安息香酸塩1部、ベントナイト2部、焼成珪藻土2部、ホホワイトカーボン1部、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩1部及び軽質炭酸カルシウム8.2部からなる原末組成物を混合被覆し、乾燥させることにより被覆型粒剤を得る。

##### 試験例1（育苗箱施用によるコブノメイガに対する効力試験1）

供試薬剤： エマメクチン安息香酸塩1%乳剤を希釈して用いた。

##### 方法：

1/10000aのワグナーポットに土壌1リットルを詰め、水を加えて攪拌し、一昼夜放置して沈静を待った。布糸により3日間水を抜いた後、ポットの土面中央部に直径1.2cm、深さ2cmの穴をあけ、イネ苗（品種：玉錦、本葉2.5葉期苗）5本を入れた後、根と薬剤が触れないように軽くポット内と同一の土壌で覆土し、所定薬量になるように希釈された水溶液1mlを穴に処理する。炭酸カルシウム処理区には続いて炭酸カルシウム50mgを処理する。更に、土壌で穴を埋めて、育苗箱施用を模した薬剤処理とした。各濃度につき2ポット処理した。

#### 【0026】

処理7日後、処理14日後、処理21日後、処理28日後、処理35日後及び処理42日後に、各区の稲株5株から葉を2枚ずつ採集し、ろ紙を敷いた直径9cmのシャーレに水2mlを入れ、採集した10枚の葉を4-5cmの長さに切り揃えて入れた。コブノメイガの2齢幼虫を筆の先で拾い、シャーレに5頭ずつ入れてフタをした。1薬剤にシャーレ2枚を用いた。虫を収容したシャーレを25℃の室温に置き、4日後に死虫率を調査した。

##### 結果：

#### 【0027】

##### 【表1】

第 1 表

No.	有効 成分量 g/箱	炭酸カル シウム mg	死 虫 率 %					
			7 日後	14 日後	21 日後	28 日後	35 日後	42 日後
1	0.5	50	100	100	100	100	100	60
2	0.25	50	100	100	100	100	50	10
3	0.125	50	100	100	100	100	50	0
比 較								
4	0.5	0	100	90	20	-	-	-
5	0.25	0	100	80	0	-	-	-
6	0.125	0	100	70	0	-	-	-
無処理			0	0	0	0	0	0

【0028】

試験例2（育苗箱施用によるコブノメイガに対する効力

試験I I）

供試薬剤：

下記組成から成る粒剤を通常の方法に従い調製した。

【0029】

【表2】

組 成	供試製剤 (重量%)			
	A	B	C	D
エマメクチン安息香酸塩(原体60%)	1.75	1.75	1.75	1.75
ホワイトカーボン	1.0	1.0	1.0	1.0
リグニンスルホン酸Na塩	2.0	-	2.0	-
カルボキシメチルセルロースNa塩	2.0	1.0	2.0	1.0
ジオクチルスルホコハク酸Na塩	0.2	0.025	0.2	0.025
ポリオキシアルキレンアリアル フェニルエーテル硫酸ナトリウム	2.0	0.5	2.0	0.5
軽質炭酸カルシウム	-	8.19	-	-
ベントナイト	6.0	2.0	6.0	2.0
焼成珪藻土	-	-	-	1.0
重質炭酸カルシウム	残分	-	-	-
タルク	-	-	残分	-
炭酸カルシウム粒	-	残分	-	-
珪砂	-	-	-	残分

## 【0030】

方法:

1/10000aのワグナーポットに土壌1リットルを詰め、水を加えて攪拌し、一昼夜放置して沈静を待った。布糸により3日間水を抜いた後、ポットの土面中央部に直径1.2cm、深さ2cmの穴をあけ、イネ苗(品種:玉錦、本葉2.5葉期苗)5本を入れた後、供試薬剤を穴に処理した。更に、土壌で穴を埋めて、育苗箱施用を模した薬剤処理とした。処理量は、育苗箱当たり各粒剤50g、25g、12.5g相当量となるようにし、各薬剤につき、5ポット処理した。

## 【0031】

処理7日後、処理14日後、処理21日後、処理28日後、処理35日後、処理42日後、処理49日後、処理56日後及び処理63日後に、各区の稲株2株から葉を5枚ずつ採集し、ろ紙を敷いた直径9cmのシャーレに水2mlを入れ、採集した10枚の葉を4-5cmの長さに切り揃えて入れた。コブノメイガの2齢幼虫を筆の先で拾い、シャーレに5頭ずつ入れてフタをした。1薬剤にシャーレ2枚を用いた。虫を収容したシャーレを25℃の室温に置き、4日後に死虫率を調査した。

結果:

## 【0032】

## 【表3】

第2表

供試 製剤	有効 成分量 g/箱	死虫率 %								
		7 日後	14 日後	21 日後	28 日後	35 日後	42 日後	49 日後	56 日後	63 日後
A	0.5	100	100	100	100	100	100	100	100	80
	0.25	100	100	100	100	100	90	30	-	-
	0.125	100	100	100	100	80	20	-	-	-
B	0.5	100	100	100	100	100	100	100	100	80
	0.25	100	100	100	100	90	40	-	-	-
	0.125	100	100	100	100	70	20	-	-	-
C	0.5	100	100	100	90	40	20	-	-	-
	0.25	100	100	100	70	30	-	-	-	-
	0.125	100	80	20	40	0	-	-	-	-
D	0.5	100	100	100	70	60	50	-	-	-
	0.25	100	100	100	40	10	-	-	-	-
	0.125	100	70	60	30	0	-	-	-	-
無処理	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0

## 【0033】

試験例3（稲体中の有効成分の含有量の測定）

供試薬剤：

エマメクチン安息香酸塩（註参照）をジメチルホルムアミド及びソルポールに溶解させた後、水を加えて懸濁させエマメクチン原液とした。これを飽和炭酸カルシウム水溶液に添加し、0.1ppm及び0.02ppmのエマメクチン供試薬液を調製した。

## 【0034】

対照薬剤は飽和炭酸カルシウム水溶液の代わりに水にエマメクチン原液を添加した。

方法：

水稻（品種：玉錦）苗（4葉期）を用いた水耕試験区（1試験区5連制）を設け、23日間水耕栽培後、所定濃度の供試薬剤と対照薬剤をそれぞれの試験区に処理し、処理3日後に稲の地上部をはさみで切り取った。これを細切りした5gの葉部を500mL（内径70mm）の広口ビンにとり、アセトニトリル／水混液（80／20，v／v）120mLを加えて超高速磨砕抽出器で5分間磨砕抽出した。抽出液を同混液で200mLに

定容後、10mL（試料0.25g相当量）をとり、水10mLを加えてC18ミニカラムの供試液とした。

## 【0035】

あらかじめ、アセトニトリル5mL及び水10mLで洗浄したC18ミニカラムに前述の供試液を添加した。次いで、容器を水5mLで洗浄し、洗液を同様に添加して流下した後、アセトニトリル／水混液（50／50，v／v）5mLを加えて流下した。溶出液を捨てた後、アセトニトリル／アンモニア水混液（95／5，v／v）25mLでエマメクチンを溶出させた。

## 【0036】

溶媒除去後、アセトニトリル／メタノール／2%酢酸アンモニウム混液（47／41／12，v／v）を一定量加えて残留物を溶解し、この液20μLを試料自動注入装置を用いてあらかじめ設定したLC-MS/MSに注入した。クロマトグラフデータ処理装置を用いてピーク面積を測定し、あらかじめ作成した検量線関係式より、エマメクチンB<sub>1a</sub>及びエマメクチンB<sub>1b</sub>を定量した。残留濃度を下式により算出する。

## 【0037】

【数1】

$$\text{残留濃度(ppb)} = \frac{\text{検出量(ng)}}{1000} \times \frac{\text{最終液量(mL)} \times 1000}{\text{注入量20}(\mu\text{L})} \times \frac{1}{\text{試料採取量 0.25(g)}} \times 1000$$

a) 分析操作に従い0.25gで表示する

【0038】

\*結果:

(註) エマメクチン安息香酸塩 (B<sub>1a</sub>:B<sub>1b</sub>=9 10 【0039】

5:5)

\* 【表4】

第3表

稲体中のエマメクチン (エマメクチンB<sub>1a</sub>+エマメクチンB<sub>1b</sub>) 濃度

試験濃度	炭酸カルシウム	エマメクチンB <sub>1a</sub> (ppb)			エマメクチンB <sub>1b</sub> (ppb)		
		実測値	平均値		実測値	平均値	
0.1ppm	+(有)	33.1	22.1	27.6	2.3	2.0	2.1
	-(無)	13.8	12.1	12.9	0.8	0.8	0.8
0.02ppm	+(有)	10.1	8.0	9.1	0.7	0.5	0.6
	-(無)	4.2	<3.8	4.2, <3.8	0.3	<0.2	0.3, <0.2

【0040】

を加えることにより、稲体中のマクロライド系化合物の  
吸収濃度が増大し、結果的に、有効な病害虫防除を達成

【発明の効果】

本発明は、前記実施例に示すとおり、マクロライド系化 30  
合物にアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸カルシウム  
することができる。

フロントページの続き

(72)発明者 渋谷 克彦

栃木県河内郡南河内町緑6-14-4

(72)発明者 江本 暁

栃木県小山市駅東通り1-23-13

(72)発明者 池上 直人

栃木県小山市駅南町1-12-32

Fターム(参考) 4H011 AC01 BA02 BA06 BB09 BB15 BB21 BC07 BC18 BC19 BC20

DA02 DD01 DF04 DH03 DH10